

⑤ Int.Cl.⁴

A 61 K 9/02

識別記号

庁内整理番号

D-6742-4C

④ 公開 昭和62年(1987)8月1日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全5頁)

⑬ 発明の名称 坐 剤

⑰ 特 願 昭61-15228

⑱ 出 願 昭61(1986)1月27日

⑲ 発 明 者 古 川 幹 夫 宇都宮市平松本町416の4

⑳ 発 明 者 原 健 次 宇都宮市氷室町1022-53

㉑ 出 願 人 花 王 株 式 会 社 東京都中央区日本橋茅場町1丁目14番10号

㉒ 代 理 人 弁理士 有賀 三幸 外2名

明 細 書

1. 発明の名称

坐 剤

2. 特許請求の範囲

1. 坐剤先端部に25℃で400~200,000cPの粘度を有する物質が付着または配合されていることを特徴とする坐剤。

3. 発明の詳細な説明

〔産業上の利用分野〕

本発明は坐剤、さらに詳細には肛門への挿入が容易であり、特に痔疾患患者にあつては挿入時の疾患部の痛みが軽減された坐剤に関する。

〔従来の技術〕

従来より広く使用されている坐剤は、基剤として脂肪酸トリグリセリドを主成分とする常温固型の油脂性基剤やポリエチレングリコールを主成分とする常温固型の水溶性基剤を用い、これに一種あるいは二種以上の主薬を配合混和した単層坐剤が一般的である。ここで使用される坐剤基剤の融点は、一般には肛門への挿入時、坐剤をつかん

だ指を坐剤が溶けて汚すことがないように、また肛門内に挿入された坐剤が直腸内で次第に溶融し主薬を放出するよう直腸内温度付近に設計されている。すなわち35~38℃の間のある一定の融点を有する坐剤基剤がもつばら使用されている。

〔発明が解決しようとする問題点〕

しかしながら、上述のように直腸内温度付近のある一定の温度に融点が設定されている単層坐剤は次のような問題点を有している。すなわち、融点が直腸内温度に近い値やわずかにその値より高温に設定された坐剤では、坐剤の融点が肛門付近の体表面温度より高いため、指で坐剤を保持し肛門内へ挿入するとき指の表面温度で溶融することがないため、指を汚すことが少ない反面、坐剤先端部が肛門体表面温度にて溶融しないので肛門への坐剤の挿入が困難であり、さらに痔疾患患者においては、患部に坐剤先端部が固型のまま接触し、挿入時の痛みや挿入後の異和感がはなはだ大きいという欠点を有している。

一方直腸内温度より若干低めに融点が設定され

た坐剤では、坐剤挿入時肛門体表面に坐剤先端部が接触するやいなや坐剤先端部の一部あるいは表面が溶融し潤滑油的な作用をするため、肛門内への挿入は容易であり、また痔疾患部に刺激を与えたりすることはなく挿入後の異和感も少ないが、反面指で坐剤を保持し肛門へ挿入するとき、指体表面温度にて保持した坐剤表面が溶融し指を汚してしまうという使用上の欠点を有している。このため、肛門への挿入が容易であり、特に痔疾患患者においては患部への刺激が少なく、また異和感のないかつ指を汚すことのない、使用感に優れた坐剤の開発が熱望されている。

〔問題点を解決するための手段〕

本発明者らは、かかる従来の坐剤の欠点を克服すべく鋭意研究を行なつた結果、特定の粘度を持つ半固型状物質を坐剤の先端部に付着または配合せしめることにより、肛門内への坐剤の挿入が容易で特に痔疾患患者にあつては痔疾患部への刺激が少なく、また異和感もなく、かつ挿入時に指を汚すことのない使用感に優れた坐剤が得られること

を見い出し、本発明を完成した。

すなわち、本発明は坐剤先端部に25℃で400～200,000 cpの粘度を有する物質が付着または配合されていることを特徴とする坐剤を提供するものである。

本発明において坐剤先端部とは、坐剤を肛門に挿入する際の挿入される側をいい、これと反対側、すなわち指にて保持する側を坐剤基部という。

本発明に用いられる25℃で400～200,000 cpの粘度を有する物質としては、白色ないし黄色ワセリン、ラノリンアルコール、ラノリン、ヤシ油、豚油、平均分子量400～600のポリエチレングリコール等が挙げられる。また、これらの物質は二種以上を混合して用いても、これらに各種界面活性剤を併用してクリーム状としたものでもよい。

本発明坐剤に用いられる物質の粘度は、極めて重要である。すなわち、25℃で400 cp未満の場合、粘度が小さすぎるため、坐剤を容器より取り出し、指ではさんだ時、坐剤先端部に付着ま

たは配合された物質が坐剤先端部より流れ落ち、指を汚してしまふ可能性があるため不適当である。また25℃で200,000 cpより大きいと、該物質が坐剤を肛門へ挿入する際の潤滑油的な作用をすることによつて、挿入が容易になるという本発明の効果を充分奏さない。

本発明坐剤先端部に付着または配合される物質の量は、坐剤に対し、0.1～10.0重量%（以下単に%と記す）が好ましい。0.1%未満であると、挿入時の潤滑油的な作用が弱く、また10%を越え、坐剤使用時肛門がべとつくなど汚れの原因となる。しかしながら、坐剤挿入時の容易さ、使用感はいずれも坐剤先端部に付着または配合される物質の粘度及び配合量に作用され、挿入が容易で使用感の良好なものとしては、粘度が5000～200,000 cpのものを坐剤に対し1～10%配合するのがさらに好ましい。

坐剤基剤としては一般に用いられている基剤を使用することができ、脂肪酸グリセライドを主成分とする常温で固型状の油脂性基剤やポリエチレ

ングリコールを主成分とする常温で固型状の水溶性基剤をあげることができる。油脂性基剤としてはカカオ脂、ラウリン脂、イソカカオ[®]（花王[®]製）、ウイテブゾル[®]（ダイナミットノーベル社製）、サボシア[®]（ガッテフオツセ社製）、SB[®]（鐘淵化学工業[®]製）、フアーマゾル[®]（日本油脂[®]製）等があげられる。また水溶性基剤としてはマクロゴール400、マクロゴール600、マクロゴール1000、マクロゴール1500、マクロゴール1540、マクロゴール4000、マクロゴール6000等の1種又は2種以上の混合物を例示することができる。なおこれら油脂性基剤や水溶性基剤に界面活性剤等の添加物を加えたものも使用することができる。しかしながら一般に坐剤は指ではさまれ肛門に挿入されるため、指の表面温度で坐剤が溶融し、指を汚すことがあつてはならない。このため本発明に用いられる坐剤基剤の融点は34℃より高いことが必要である。これより低い融点であると指を汚すことが多く時として坐剤の使用経験の少ない初心者においてはその傾向が強い。

なおここで示した坐剤基剤の融点は、各種薬物や添加剤を加えた後の坐剤製品としての融点を示す。

本発明坐剤は、例えば25℃で400~200,000 cpの粘度を有する物質を加温して流動性を持たせ、坐剤製造用容器の先端部に滴下した後、あらかじめ所定の方法によつて薬物を配合・混合し、加温溶解させた坐剤基剤を当該容器に流し込むことによつて製造することができる。

〔作用〕

本発明の坐剤は坐剤を肛門に挿入する際に痛みや異和感の軽減と坐剤をつかんだ指の汚れを防ぐためのものであり、その作用機序は指体表面温度より融点の高い坐剤基剤を坐剤基部に用いることにより、坐剤の溶解による指の汚れを防ぐことができ、さらに坐剤先端部に付着または配合された特定の粘度を有する物質が坐剤挿入時に潤滑油的な作用をするものと考えられる。

〔発明の効果〕

本発明の坐剤は後記実施例に示すごとく、坐剤の挿入時の痛みや異和感を軽減し、かつ坐剤をつ

まんだ指の汚れを防ぐことができる。従つて従来の坐剤に比べ、痔疾患者の挿入時の使用感において著しく改善され、重症の痔疾患者だけでなく初心者においても安心して使うことができる。

〔実施例〕

次に実施例を挙げて本発明を説明する。

実施例1

局方、白色ワセリンを70℃に加温し融解した。この白色ワセリンを深さ30mm、中央部の内径9mm、内容量1.75mlの塩化ビニル製プラスチックコンテナ（以下単にコンテナと示す）に注入した。あらかじめ別に融解しておいた油脂性基剤イソカカオ MO-5（花王製、融点36℃）、あるいはMO-5 96部に中鎖脂肪酸トリグリセライド（ $C_8 \sim C_{12}$ ）を4部加え加熱溶解し混合した坐剤基剤（融点約33℃、MO-5・Tと記す。）を流し込み、室温に放置して坐剤を得た。このように試作した坐剤A~H及び市販品a, bを、坐剤を使用している痔疾患者各10名の肛門にそれぞれ挿入し、挿入時の痛みや異和感、また指の汚

れ等について評価した。結果を表-1に示す。その結果、坐剤基剤として融点36℃のMO-5を用い、白色ワセリンが0.1~10.0%注入された坐剤において良好な使用感が得られた。

以下余白

表 - 1

坐 剤 名	白色ワセリン 注入量 (g)	坐剤基剤の種類及び注入量 (g)	評 価 結 果				
			挿入時 の痛み	挿入し やすさ	異和感	肛門の 汚れ	指の汚れ
A	—	MO-5 1.6	痛 い	不 良	有	無	無
B	0.016	MO-5 1.584	痛くない	良	無	、	、
C	0.08	MO-5 1.52	、	、	、	、	、
D	0.16	MO-5 1.44	、	、	、	、	、
E	0.32	MO-5 1.28	、	、	、	有	、
F	0.48	MO-5 1.12	、	、	、	、	、
G	0.016	MO-5・T 1.584	、	、	、	無	有
H	0.16	MO-5・T 1.44	、	、	、	、	、
市販品 a	—	油脂性基剤 (m.p. 37℃)	痛 い	不 良	有	、	、
市販品 b	—	油脂性基剤 (m.p. 35℃)	、	、	、	、	無

実施例 2

粧原基ラノリンを70℃に加熱し融解した。このラノリンを表-2に示したように深さ30mm、中央部の内径9mm、内容量1.75mlの塩化ビニル製プラスチックコンテナに注入した。あらかじめ別に融解しておいたマクロゴール1500(M-1500)またはマクロゴール4000(M-4000)を流し込み室温に放置し、坐剤を得た。

このように試作した坐剤I~Nを坐剤使用経験のある痔疾患患者各10名のそれぞれの肛門に挿入し、挿入時の痛みや異和感、また指の汚れ等について検討した。結果を表-2に示す。

ラノリンを0.1~10.0%注入した坐剤において良好な使用感を得た。

以下余白

表 - 2

坐剤名	ラノリンの 注入量(g)	坐剤基剤の種類及び注入量 (g)		評 価 結 果				
				挿入時の痛み	挿入し やすさ	異和感	肛門の 汚れ	指の汚れ
I	—	M-1500	1.6	痛 い	不 良	有	無	無
J	0.016	M-1500	1.584	あまり痛くない	良	無	・	・
K	0.16	M-1500	1.44	ほとんど痛くない	・	・	・	・
L	—	M-4000	1.6	痛 い	不 良	有	・	・
M	0.016	M-4000	1.584	あまり痛くない	良	無	・	・
N	0.16	M-4000	1.44	ほとんど痛くない	・	・	・	・

実施例 3

下記組成の局方、親水軟膏をそれぞれ加温し前述のコンテナにそれぞれ 0.16 g 注入した。あらかじめ別に融解しておいたインカカオ MO-5 を 1.44 g 流し込み室温に放置し、坐剤を得た。

これら坐剤を得た患者 10 名に使用させたところ、挿入時のいたみがなくかつ指の汚れも認められなかった。

親水軟膏（局方）：

白色ワセリン	250 (部)
ステアリルアルコール	220
プロピレングリコール	120
ラウリル硫酸 Na	15
エチルパラベン	0.25
プロピルパラベン	0.15
精製水	合計 1000 部となる量

吸水軟膏（局方）：

白色ワセリン	400 (部)
セタノール	180
セスキオレイン酸ソルビタン	50

ラウロマクロゴール	5
エチルパラベン	1
ブチルパラベン	1
精製水	合計 1000 部となる量

以 上

出 願 人 花 王 株 式 会 社

代 理 人 弁 理 士 有 賀 三 幸

弁 理 士 高 野 登 志 雄

弁 理 士 小 野 信 夫